

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

REC'D. 15 DEC 2004

WIPO PCT

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 53010AWO	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/PEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/08192	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 25.07.2003	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 25.07.2002
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK A61K31/565		
Anmelder SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

☒ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt 4 Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Bescheids
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 16.02.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 13.12.2004
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde <div style="display: flex; align-items: center;"> <div> Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465 </div> </div>	Bevollmächtigter Bediensteter Venturini, F Tel. +49 89 2399-7847



INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/08192

I. Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):

Beschreibung, Seiten

1-12 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-12 eingegangen am 29.05.2004 mit Schreiben vom 25.05.2004

Zeichnungen, Blätter

1/2-2/2 in der ursprünglich eingereichten Fassung

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um:

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
 - ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
 - ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).
3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:
- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
 - ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
 - ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
 - ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
 - ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
 - ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.
4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
- ☐ Beschreibung, Seiten:
 - ☐ Ansprüche, Nr.:
 - ☐ Zeichnungen, Blatt:

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER
PRÜFUNGSBERICHT**

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/08192

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

- | | |
|--------------------------------|---------------------------------------|
| 1. Feststellung | |
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 1-12
Nein: Ansprüche |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche 1-12
Nein: Ansprüche |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche 1-12
Nein: Ansprüche |

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

TEIL V

- 1 Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:

D1: WO 02 49622

D2: DE 196 50 352

D3: US-A-5 952 319

D1 betrifft ein Transdermalsystem, das (21S)-21-hydroxy-21-methyl-14,17-ethano-19-norpregna-4,9,15-trien-3,20-dion enthält, dadurch gekennzeichnet, dass das Transdermalsystem einen hohen Gehalt eines potenten Gestagens in gelöster Form zu Verfügung stellt.

D2 beschreibt ein oral wirksames Kombinationspräparat zur männlichen Kontrazeption, das Dehydroepiandrosteron und ein oral wirksames Gestagen enthält.

D3 betrifft androgene Steroiden, die zur Kontrolle der männliche Fertilität verwendet werden können.

- 2 Die vorliegende Anmeldung erfüllt scheinbar die Erfordernisse des Artikels 33(2) PCT, weil der Gegenstand der Ansprüche 1-12 neu ist. Die Zusammensetzung enthaltend ein androgenes 11 β -Halogensteroid beschrieben in Formel I und (21S)-21-hydroxy-21-methyl-14,17-ethano-19-norpregna-4,9,15-trien-3,20-dion ist nicht im verfügbaren Stand der Technik offenbart.

Die vorliegende Anmeldung erfüllt scheinbar die Erfordernisse des Artikels 33(3) PCT, weil der Gegenstand der Ansprüche 1-12 auf einer erfinderischen Tätigkeit beruht. Die mit der vorliegenden Erfindung zu lösende Aufgabe kann somit darin gesehen werden, daß man eine alternative Zusammensetzung zur Kontrolle der männliche Fertilität liefert. Die in der vorliegenden Anmeldung vorgeschlagene Lösung der obengenannten Aufgabe besteht in der Bereitstellung einer Zusammensetzung enthaltend ein androgenes 11 β -Halogensteroid beschrieben in Formel I und (21S)-21-hydroxy-21-methyl-14,17-ethano-19-norpregna-4,9,15-trien-3,20-dion. Diese Lösung wird als erfinderisch betrachtet, weil im Stand der Technik keine Hinweise bestehen die den Fachmann zu der obengenannte Lösung führen würden.

3. Die mit Schreiben vom 25.05.2004 eingereichten Änderungen in Ansprüche 7,9,10 sind solche, dass die oben-geannten Ansprüche scheinbar die Erfordernisse des Artikels

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER
PRÜFUNGSBERICHT - BEIBLATT**

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/08192

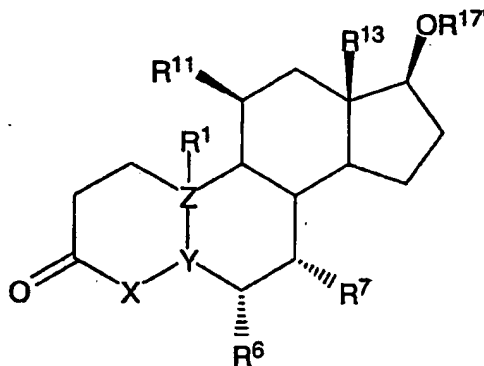
6 PCT erfüllen.

Patentansprüche

EPO-BERLIN

29-05-2004

1. Zusammensetzung, enthaltend ein androgenes 11 β -Halogensteroid, ausgewählt aus der Gruppe der Verbindungen der allgemeinen Formel I



worin

X-Y-Z eine Gruppe mit einer der beiden Strukturen CH=C-C oder CH₂-C=C darstellt,

R¹ α - und β -ständig sein kann und für Wasserstoff, R oder über P an die Ringgrundstruktur gebundenes P-Q-R steht, wobei P und Q gerad- oder verzweigt-kettige C₁- bis C₈-Alkyl-, -Alkenyl-, -Alkynylgruppen oder deren fluoriierte Derivate darstellen und gleich oder verschieden sein können und wobei R einen CH₃- oder CF₃-Rest darstellt, mit der Maßgabe, daß an Z kein Substituent R¹ vorhanden ist, wenn X-Y-Z die Gruppe CH₂-C=C darstellt,

R⁶ ein Wasserstoffatom ist oder die unter R⁷ angegebenen Bedeutungen haben kann,

R^7 für R oder über P an die Ringgrundsstruktur gebundenes P-Q-R steht, wobei diese Gruppen die vorerwähnten Bedeutungen haben,

R^{11} ein Halogen darstellt,

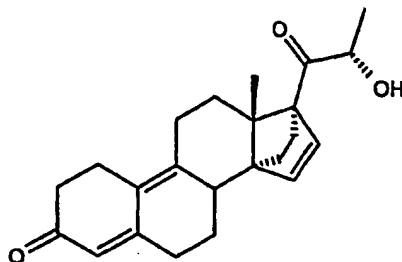
R^{13} Methyl oder Ethyl ist und

R^{17} Wasserstoff ist oder für C(O)- R^{18} steht, wobei

R^{18} ein gerad- oder verzweigt-kettiger C_1 - bis C_{18} -Alkyl-, -Alkenyl-, -Alkynylrest oder ein Arylrest ist, oder für über P an die C(O)-Gruppe gebundenes T-U-V steht, wobei T und U gerad- oder verzweigt-kettige C_1 - bis C_{18} -Alkyl-, -Alkenyl-, -Alkynylgruppen, alicyclische C_3 - bis C_{12} -Gruppen oder Arylgruppen darstellen und gleich oder verschieden sind, und V ein gerad- oder verzweigt-kettiger C_1 - bis C_{18} -Alkyl-, -Alkenyl- oder -Alkynyl- oder ein Arylrest ist oder

R^{18} eine der vorerwähnten Bedeutungen hat und zusätzlich mit einer oder mehreren Gruppen $NR^{19}R^{20}$ oder einer oder mehreren Gruppen SO_xR^{21} substituiert ist, wobei $x = 0, 1$ oder 2 und R^{19} , R^{20} und R^{21} jeweils Wasserstoff oder über T an N, S gebundenes T-U-V mit der vorerwähnten Bedeutung sind, mit der Maßgabe, daß außerdem die physiologisch verträglichen Additionssalze mit anorganischen und organischen Säuren einbezogen sind,

und das Gestagen der nachstehenden Formel.



2. Zusammensetzung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß das 11 β -Halogensteroid der allgemeinen Formel I die Verbindung 11 β -Fluor-17 β -hydroxy-7 α -methyl-estr-4-en-3-on ist.
3. Pharmazeutische Zusammensetzung, enthaltend eine Zusammensetzung gemäß Anspruch 1 sowie einen pharmazeutisch verträglichen Träger und/oder Hilfsstoffe.
4. Pharmazeutische Zusammensetzung nach Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet, daß das 11 β -Halogensteroid der allgemeinen Formel I die Verbindung 11 β -Fluor-17 β -hydroxy-7 α -methyl-estr-4-en-3-on ist.
5. Männliches Kontrazeptivum, enthaltend eine pharmazeutische Zusammensetzung gemäß Anspruch 3.
6. Männliches Kontrazeptivum, enthaltend eine pharmazeutische Zusammensetzung gemäß Anspruch 4.
7. Männliches Kontrazeptivum nach Anspruch 5 oder 6, dadurch gekennzeichnet, daß die androgene Verbindung der allgemeinen Formel I darin mittels eines Implantats kontinuierlich über eine längere Zeitdauer verabreicht wird.
8. Männliches Kontrazeptivum nach Anspruch 5 oder 6, dadurch gekennzeichnet, daß die androgene Verbindung der allgemeinen Formel I darin oral verabreicht wird.
9. Männliches Kontrazeptivum nach Anspruch 5 oder 6, dadurch gekennzeichnet, daß die androgene Verbindung darin mittels eines transdermalen Systems über eine längere Zeitdauer verabreicht wird.

10. Männliches Kontrazeptivum nach einem der Ansprüche 5-9, dadurch gekennzeichnet, daß das Gestagen darin mittels eines Implantats über eine längere Zeitdauer kontinuierlich über eine längere Zeitdauer verabreicht wird.
11. Männliches Kontrazeptivum nach einem der Ansprüche 5-9, dadurch gekennzeichnet, daß das Gestagen in einem Transdermalsystem formuliert ist.
12. Männliches Kontrazeptivum nach einem der Ansprüche 5-9, dadurch gekennzeichnet, daß das Gestagen oral verabreicht wird.